

Requested Patent: JP55124763A

Title:

TRIFLUOROMETHYL-2-PYRIDINONE OR PYRIDINTHIONE COMPOUNDS AND
PROCESS FOR THE PREPARATION OF THE SAME ;

Abstracted Patent: US4546191 ;

Publication Date: 1985-10-08 ;

Inventor(s):

NISHIYAMA RYUZO (JP); FUJIKAWA KANICHI (JP); YOKOMICHI ISAO (JP); HAGA
TAKAHIRO (JP); NAGATANI KUNIAKI (JP); HAYASHI KOUJI (JP) ;

Applicant(s): ISHIHARA MINING CHEMICAL CO (JP) ;

Application Number: US19800131719 19800319 ;

Priority Number(s): JP19790032068 19790319 ;

IPC Classification: ;

Equivalents:

BE882284, CA1134833, CH642355, DE3008908, FR2451917, GB2049666,
IT1147077, JP1502415C, JP63048865B, NL8001618 ;

ABSTRACT:

A trifluoromethyl-2-(thio)pyridone compound having the formula: wherein X represents a hydrogen atom or a halogen atom, Y1 and Y2 each represents a hydrogen atom, a halogen atom or a trifluoromethyl group, and Z represents an oxygen atom or a sulfur atom, in which either Y1 or Y2 represents a trifluoromethyl group, and when X and Y2, or X and Y1 represent a hydrogen atom at the same time, then Z represents a sulfur atom, and a process for preparing the same.

⑫ 公開特許公報 (A)

昭55—124763

⑪ Int. Cl.³
C 07 D 213/64
213/70

識別記号

庁内整理番号
7138—4C
7138—4C

⑬ 公開 昭和55年(1980)9月26日

発明の数 1
審査請求 未請求

(全 3 頁)

⑤ 5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体

⑫ 発明者 芳賀隆弘

草津市野村町221番地

⑬ 特 願 昭54—32068

⑫ 発明者 長谷邦昭

⑭ 出 願 昭54(1979)3月19日

⑫ 発明者 守山市浮気町321番地の31

⑮ 発明者 西山隆三

⑫ 発明者 林弘仁

高槻市真上町5丁目41番22号

⑫ 発明者 守山市浮気町321番地の31

⑯ 発明者 藤川敢一

⑬ 出 願 人 石原産業株式会社

守山市浮気町321番地の31

大阪市西区江戸堀1丁目3番11号

⑰ 発明者 横道勲

草津市野村町221番地

明 細 書

1. 発明の名称 5-トリフルオロメチル-2-
ピリドン誘導体

2. 特許請求の範囲

1. 一般式



(式中Xは水素原子又はハロゲン原子であり、Yは酸素原子又はイオウ原子である。但し、Xが水素原子の場合、Yはイオウ原子である。)で表わされる5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体。

3. 発明の詳細な説明

本発明は医薬、農薬、染料などの中間原料として有用で、新規な5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体に関する。

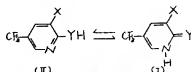
詳しくは本発明は一般式



(I)

(式中Xは水素原子又はハロゲン原子であり、Yは酸素原子又はイオウ原子である。但し、Xが水素原子の場合、Yはイオウ原子である。)で表わされる5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体である。

前記一般式(I)の5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体は、次に示すような互変異性として存在することができる。

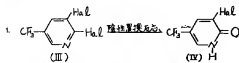


(II)

(式中X及びYは前述の通りである)

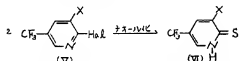
前記一般式(I)において、Xで表わされるハロゲン原子としては弗素、塩素、臭素、ヨウ素が挙げられる。

本発明の5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体は通常、例えば下記方法によって製造される。



(上記反応式中 Hal はハロゲン原子である)

一般に上記反応はジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミドなどの非プロトン性極性溶媒中、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどのアルカリ水溶液を用いて50～150℃、0.1～10時間で行なわれる。



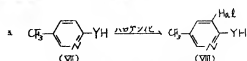
(上記反応式中 X 及び Hal は前述の通りである)

一般に上記反応はメタノール、エタノールなどのアルコール類、ジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミドなどの非プロトン性極性溶

- 3 -

特開昭55-124763(2)

媒などの溶液中、チオ尿素、硫化ソーダ、チオ硫酸ソーダ、N, N-ジメチルジチオカルバミン酸ソーダなどのチオール化剤を用いて50～還流温度0.5～10時間で行なわれる。



(上記反応式中 Y 及び Hal は前述の通りである)

一般に上記反応は四塩化炭素、クロロホルム、酢酸、二硫化炭素、水、非プロトン性極性溶媒などの溶液中、塩素ガス、臭素、チオニクロライド、スルファリルクロライドなどのハロゲン化剤を用いて0～100℃、0.5～10時間で行なわれる。

本発明化合物は、例えばハロゲン化ニトロベンゼン類と縮合させて4-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イルオキシ)ニトロベンゼン類を生じさせ、これを還元して得られる4-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イルオキシ)アニリン類とベンズイルイソシアネ

- 4 -

ート類とを反応させることによりN-ベンズイル-N'-(4-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イルオキシ)フェニル)ウレア系化合物に誘導できる。詳しくは本発明化合物の3-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ピリドンと3,4,5-トリクロロニトロベンゼンとを縮合、還元して3,5-ジクロロ-4-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イルオキシ)アニリンを得、更にこのものと2,6-ジフルオロベンズイルイソシアネートとを反応させると、N'-(2,6-シフルオロベンズイル)-N-(3,5-ジクロロ-4-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イルオキシ)フェニル)ウレアを得ることができる。このものは殺虫剤の有効成分として優れた活性を示し、種々の有害虫、特に有害昆虫の防除に有効であって、例えばはこの化合物の100 ppm水分散液にキャベツの葉片を浸漬し、それを風乾してそこへ2～3令のコナガの幼虫を放ち、8日目生死を判定した結果、100%の

- 5 -

死虫率が得られた。

次に本発明化合物の具体的合成例を記載する。
合成例 1. 3-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ピリドン

(A)

5-トリフルオロメチル-2-ピリドン 0.2 g をクロロホルム 20 ml に溶解させ、50℃に加熱して塩素ガスを1時間攪拌下に通じた。反応終了後、クロロホルムを留去し、トルエン-n-ヘキサンの混合溶液で再結晶して融点144～147℃の目的物0.15 gを得た。

(B)

水酸化ナトリウム 2.4 g を水 12.5 ml に溶解させた水溶液に2,3-ジクロロ-5-トリフルオロメチルピリジン 4 g を加え、更にジメチルスルホキシド 12.5 ml を加えて加熱し、110℃で1時間攪拌下で反応させた。反応終了後生成物を放冷し、濃塩酸で酸性にして沈殿物を得、このものを濾過して目的物 2.5

- 6 -

ヲを得た。

合成例 2 5-トリフルオロメチル-2-チオ
ピリドン

2-クロロ-5-トリフルオロメチルピ
リジン4ヲとチオ尿素1.67ヲとをエタノール
30mlに溶解させ、加熱して還流状態で3時
間煮沸下に反応させた。その後、水酸化カリ
ウム水溶液1.23ヲを徐々に加えて還流状態
で1時間反応させた。反応終了後、生成物を
放冷し、希アルカリ水溶液中に投入して塩化
メチレンで洗浄し、酢酸で酸性にした。次い
で、塩化メチレンで抽出し、抽出層を水洗後
無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、塩化メチレ
ンを留去して融点147~150℃の目的物
2.1ヲを得た。

合成例 3 3-ブロモ-5-トリフルオロメチ
ル-2-ピリドン

5-トリフルオロメチル-2-ピリドン0.
4ヲを酢酸10mlに溶解させ、そこへ臭素0.
4ヲを加えて煮沸下で4時間反応させた。反

- 7 -

特開昭55-124763(3)

応終了後、酢酸を留去し、塩化メチレン-n
-ヘキサンの混合溶媒で再結晶して融点162
~165℃の目的物0.45ヲを得た。

合成例 4 3-クロロ-5-トリフルオロメチ
ル-2-チオピリドン

2-クロロ-5-トリフルオロメチルピ
リジン4ヲに代えて2,3-ジクロロ-5-トリ
フルオロメチルピリジン4.75ヲを用いる以
外は前記合成例2と同様にして反応を行ない、
後処理を行なって融点125~128℃の目
的物1.9ヲを得た。

特許出願人 石原産業株式会社

- 8 完 -